

SAMANTEKT Á EIGINLEIKUM LYFS

1. HEITI LYFS

Xylocain 20 mg/g hlaup.

2. INNIHALDSLÝSING

1 g af Xylocain hlaupi inniheldur: Lidocainhýdróklóríð 20 mg.

Hjálparefni með þekkta verkun:

Methýlparahýdroxýbenzóat (E218)

Própýlparahýdroxýbenzóat

Sjá lista yfir öll hjálparefni í kafla 6.1.

3. LYFJAFORM

Hlaup.

Xylocain hlaup er tært eða næstum tært, lítið eitt litað hlaup.

4. KLÍNÍSKAR UPPLÝSINGAR

4.1 Ábendingar

Til yfirborðsdeyfingar við speglunarrannsóknir.

- Blöðruspeglun, þegar verið er að koma fyrir legg, við ómskoðun og aðrar aðgerðir á þvagrás hjá körlum og konum.
- Í nef og nefkok við speglun t.d. magaspeglun og berkjuspeglun.
- Við endaparms- og ristilspeglun.
- Barkaþræðing (tracheal intubation).

Til verkjadeyfingar í tengslum við blöðrubólgu og þvagrásarbólgu.

Til verkjadeyfingar eftir umskurð hjá drengjum.

Ábendingar fyrir Xylocain hlaup eiga við um fullorðna og börn á öllum aldri.

4.2 Skammtar og lyfjagjöf

Xylocain hlaup veldur skjótri og mikilli deyfingu á slímhúðum og deyfing helst lengi (u.þ.b. 20-30 mín.). Deyfing kemur venjulega fljótt fram (innan 5 mín. háð því svæði sem lyfið er notað á).

Eins og við á um önnur staðdeyfilyf byggist öryggi og verkun lidocains á réttum skammti, réttum notkunarhætti, viðeigandi varkárni og þess að vera viðbúin hættuástandi.

Eftirfarandi skammtar eru til leiðbeiningar. Reynsla og þekking læknis á líkamlegu ástandi sjúklings er mikilvæg við útreikning á viðeigandi skammti.

Frásog um slímhúðir er breytilegt, en er sérstaklega mikið frá berkjum. Frásog Xylocain hlaups í nefholi er venjulega minna en úr öðrum lyfjaformum sem innihalda lidocain. Blóðþéttni lidocains eftir notkun hlaupsins á óskaddaða þvagrás og þvagblöðru í skömmtum allt að 800 mg er frekar lág og undir þéttni sem veldur eitrun.

Á lasburða eða aldraða sjúklinga, börn eldri en 12 ára, alvarlega veika sjúklinga eða sjúklinga með blóðsýkingu (sepsis) skal nota skammta í samræmi við aldur, þyngd og líkamlegt ástand.

Hjá börnum yngri en 12 ára skal hver einstakur skammtur ekki vera meiri en 6 mg/kg líkamspunga.

Ekki skal nota fleiri en 4 skammta á sólarhring.

Staðdeyfing þvagrásar

Staðdeyfing á yfirborði þvagrásar hjá fullorðnum körlum: Til viðunandi staðdeyfingar hjá körlum þarf 20 ml (=400 mg) af hlaupi. Hlaupinu er sprautað hægt þar til sjúklingurinn finnur fyrir þenslu eða þar til um helmingur af innihaldi túpunnar (10 ml = 200 mg) hefur verið notaður. Þá er klemma sett um reðurhúfukrónu í nokkrar mínútur, síðan er afgangnum af hlaupinu sprautað.

Þegar staðdeyfing er sérlega mikilvæg, t.d. við ómskoðun eða blöðruspeglun má nota meira magn af hlaupi (t.d. 30-40 ml) í 3-4 skömmtum og bíða síðan í 10 mín. áður en tækjum er komið fyrir. Notkun hlaupsins í þvagblöðru fyrir aðgerð á því svæði er líka áhrifaríkt.

Staðdeyfing á yfirborði þvagrásar hjá konum: 5-10 ml af hlaupinu er sprautað í litlum skömmtum og þvagrásin fyllt. Til þess að ná fram viðunandi deyfingu skal bíða í nokkrar mínútur áður en þvagfæraaðgerð er hafin.

Speglun

Mælt er með að sprauta 10-20 ml til þess að fá viðunandi deyfingu og nota má lítið magn til þess að smyrja speglunartæki. Við notkun ásamt öðrum lyfjum sem innihalda lidocain (t.d. við berkjuspeglun), má heildarskammtur lidocains ekki vera meiri en 400 mg.

Endaparms- og ristilspeglun

Nota má allt að 20 ml við endaparms- og ristilaðgerðir. Heildarskammtur lidocains má ekki vera meiri en 400 mg.

Smurning þegar barkaslöngu er komið fyrir

Smyrja má um 2 ml af hlaupinu á yfirborð slöngunnar áður en henni er komið fyrir. Varast skal að hlaupið berist inn í holrými slöngunnar.

Skert nýrnastarfsemi:

Nota skal lyfið með varúð hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfsemi (sjá kafla 4.4).

Skert lifrastarfsemi:

Nota skal lyfið með varúð hjá sjúklingum með skerta lifrastarfsemi (sjá kafla 4.4).

4.3 Frábendingar

Ofnæmi fyrir staðdeyfilyfjum af amíðflokki eða einhverju hjálparefnanna sem talin eru upp í kafla 6.1.

Ofnæmi fyrir metýl og/eða própýlparahýdroxýbenzoati (metýl-/ própýlparabonar) eða umbrotsefninu para-amínó-benzósýru (PABA). Forðast á notkun lidocain lyfja sem innihalda parabena hjá sjúklingum sem eru með ofnæmi fyrir staðdeyfilyfjum af ester-gerð eða umbrotsefni þeirra, PABA.

4.4 Sérstök varnaðarorð og varúðarreglur við notkun

Mjög stórir skammtar af lyfjum sem innihalda lidocain eða ef stutt er á milli skammta, geta valdið hárrí þéttni í plasma og alvarlegum aukaverkunum. Sjúklingum skal leiðbeina um að nota aðeins þá skammta sem mælt er fyrir um (við meðferð á alvarlegum aukaverkunum getur reynst nauðsynlegt að nota tæki til endurlífgunar, súrefni og önnur endurlífgunarlyf). (Sjá kafla 4.9).

Frásog frá yfirborði sára og slímhúðar er tiltölulega mikið og sérstaklega mikið í berkjum. Frásog lidocains úr hlaupinu í nefholi er breytilegt en yfirleitt lítið miðað við önnur lyf sem innihalda lidocain. Eftir að lyfinu hefur verið sprautað í þvagrás og þvagblöðru er frásog lítið. Nota á lidocain hlaup með varúð handa sjúklingum með skaddaða slímhúð og/eða sýkingu (sepsis) á því svæði sem lyfið er notað á.

Staðeyfilyf til notkunar á slímhúð í munni og koki geta truflað kyngingu og þar með aukið hættu á að sjúklingi svelgist á. Dofin tunga og slímhúð í munni geta aukið hættu á að sjúklingur bíti sig.

Þegar lyfið er notað til þess að smyrja barkaslöngu, skal varast að hlaupið berist inn í holrými slöngunnar. Hlaupið getur þornað á innra yfirborðinu og leifarnar hafa tilhneigingu til að safnast fyrir þar sem beygja er á slöngunni og þrengja holrýmið. Mjög sjaldan hafa borist tilkynningar um að leifarnar hafi valdið því að holrýmið stíflist.

Sjúklingar sem fá meðferð með lyfjum af flokki III við hjartsláttartruflunum (t.d. amiodaron) eiga að vera undir nánu eftirliti og hafa á í huga að taka hjartarafrit þar sem áhrif á hjartað geta verið samleggjandi.

Ef skammtur eða það hvernig lyfjagjöf er háttáð eru líkleg til að valda hárrí blóðþéttni þarf sérstakt eftirlit með sumum sjúklingum til að koma í veg fyrir alvarlegar aukaverkanir:

- Sjúklingar með gáttasleglarof að hluta til eða að fullu, þar sem staðeyfilyf geta dregið úr leiðni í hjartavöðva.
- Aldraðir og lasburða sjúklingar.
- Sjúklingar með langt genginn lifrarsjúkdóm eða alvarlega skerta nýrnastarfsemi.
- Sjúklingar með kransæðasjúkdóm eða hjartabilun.
- Sjúklingar með flogaveiki, hægslátt, blóðþurrð, í losti, með Wolf-Parkinsons-Whites heilkenni eða taugasjúkdóma.

Nota skal lyfið með varúð hjá sjúklingum með endurtekna porfýríu.

Xylocain hlaup inniheldur metýlparahýdroxýbensóat (E218) og própýlparahýdroxýbenzóat sem getur valdið ofnæmisviðbrögðum (hugsanlega síðkomnum) og í undantekningartilvikum, berkjukrampa.

4.5 Milliverkanir við önnur lyf og aðrar milliverkanir

Lidocain skal nota með varúð ef sjúklingur fær einnig lyf sem eru skyld staðeyfilyfjum að byggingu, þar sem eiturvekanir eru samverkandi.

Ekki hafa verið gerðar sérstakar rannsóknir á milliverkunum lidocains og lyfja af flokki III við hjartasláttartruflunum (t.d. amiodaron) en mælt er með að varúðar sé gætt við meðhöndlun sjúklinga (sjá einnig kafla 4.4).

Lyf sem draga úr úthreinsun lidocains (t.d. cimetidin eða betablokkar) geta mögulega valdið eitrunarþéttni í plasma þegar lidocain er gefið í endurteknum stórum skömmtum í langan tíma. Þessar milliverkanir eiga ekki að hafa klíníska þýðingu eftir meðferð með lidocaini til skamms tíma í ráðlögðum skömmtum.

Flúvoxamín minnkar úthreinsun lidocains sem svara um 40% og lengir helmingunartíma lidocains úr 2,6 klst. í 3,5 klst.

4.6 Frjósemi, meðganga og brjóstagjöf

Meðganga

Má nota á meðgöngu.

Telja má að stór þungaðra kvenna og kvenna á barneignaraldri hafi notað lidocain.

Enn sem komið er hefur ekki verið greint frá aukinni tíðni vansköpunar hjá börnum mæðra sem hafa notað staðdefilyf á meðgöngunni.

Brjóstagjöf

Má nota á meðan brjóstagjöf stendur en þó má ekki bera lyfið á geirvörtur rétt fyrir brjóstagjöf. Eins og við á um önnur staðdefilyf getur lidocain skilist út í brjóstamjól, en í svo litlum mæli að almennt er engin hættu á að það hafi áhrif á nýbura.

4.7 Áhrif á hæfni til aksturs og notkunar véla

Staðdefilyf geta, háð skammti, haft mjög væg áhrif á heilastarfsemi og tímabundið skert hreyfigetu og samhæfingu.

4.8 Aukaverkanir

Greint hefur verið frá aukinni tíðni á særindum í hálsi eftir aðgerð ef barkaslangan hefur verið smurð með lidocain hlaupi.

Ofnæmi:

Ofnæmi (í alvarlegustu tilvikum bráðaofnæmi) fyrir staðdefilyfi af amíðflokki er mjög sjaldgæft (< 1/1.000). Önnur innihaldsefni hlaupsins, t.d. metýl- og própýlparahýdróxýbenzóat, geta einnig valdið ofnæmisviðbrögðum.

Bráð almenn eitrun:

Lidocain getur valdið bráðum eiturverkunum ef blóðþéttni þess verður há vegna hraðs frásogs eða ofskömmtunar (sjá kafla 5.1 og kafla 4.9).

Tilkynning aukaverkana sem grunur er um að tengist lyfinu

Eftir að lyf hefur fengið markaðsleyfi er mikilvægt að tilkynna aukaverkanir sem grunur er um að tengist því. Þannig er hægt að fylgjast stöðugt með sambandinu milli ávinnings og áhættu af notkun lyfsins. Heilbrigðisstarfsmenn eru hvattir til að tilkynna allar aukaverkanir sem grunur er um að tengist lyfinu til Lyfjastofnunar, www.lyfjastofnun.is.

4.9 Ofskömmun

Bráðar eitranir:

Eiturverkanir verða aðallega í miðtaugakerfi og hjarta- og æðakerfi.

Eitrun í miðtaugakerfi lýsir sér með einkennum sem magnast stig af stigi hvað varðar alvarleika. Fyrstu einkennum eru tilfinningadofi í kringum munn, dofi í tungu, sundl, vönkun, ofnæm heyrn og eyrnasuð.

Sjóntruflanir og vöðvatitringur eru alvarlegri einkenni og undanboði altækra (generalised) krampa. Þessum einkennum má ekki rugla saman við taugaviðbrögð. Meðvitundarleysi og flog (grand mal) geta komið í kjölfarið, sem geta varað í fáeinum sekúndum eða allt að nokkrum mínútum. Súrefnisskortur í vef (hypoxia) og koltvísýringshækkun koma fljótt í kjölfar krampa vegna aukinnar virkni vöðva ásamt truflun á eðlilegri öndun. Öndunarstöðvun getur orðið í alvarlegum tilvikum. Blóðsýring eykur eituráhrif staðdefilyfja.

Eiturverkanir ganga til baka vegna endurdreifingar og umbrots staðdefilyfsins frá miðtaugakerfi. Einkenni geta gengið hratt til baka nema lyfið hafi verið notað í miklu magni.

Áhrif á hjarta- og æðakerfi sjást aðeins við háa almenna þéttni. Í þeim tilvikum getur afleiðingin verið alvarlegur lágþrýstingur, hægsláttur, hjartsláttartruflanir og lost (vegna hjartaáfalls). Áður en vart verður eiturverkana frá hjarta- og æðakerfi koma venjulega fyrst fram eiturverkanir frá miðtaugakerfi, nema sjúklingurinn sé undir svæfingu eða sé mjög slævður af lyfjum eins og benzodiazepini eða barbítúrötum.

Meðferð á bráðri eitrun:

Ef einkenni um bráða almenna eitrun koma fram má búast við að þau séu svipuð og einkenni í kjölfar notkunar staðdeyfilyfja, eftir öðrum íkomuleiðum. Einkenni um eitrun vegna staðdeyfilyfs koma fram sem örvun á taugakerfi, og í alvarlegum tilvikum, bæling á miðtaugakerfi og hjarta- og æðastarfsemi.

Veita á meðferð við alvarlegum taugaeinkennum, t.d. krömpum og miðtaugakerfisbælingu, eftir einkennum (öndunaraðstoð og krampaleysandi lyf).

Við blóðrásarstöðvun skal hefja án tafar hjarta- og lungnaendurlífgun. Lífsnauðsynlegt er að veita sem ákjósanlegustu súrefnismettun, öndunaraðstoð, styðja við blóðrás ásamt því að meðhöndla blóðsýringu.

5. LYFJAFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR

5.1 Lyfhrif

Flokkun eftir verkun: Staðdeyfilyf, amíð, ATC-flokkur: N 01 BB 02.

Xylocain hlaup veldur skjótri og mikilli deyfingu í slímhúðum og notkun hlaupsins með smurningu dregur úr núningi. Vatnsblandanlegur burðarfasinn einkennist af mikilli seigju og lágrri yfirborðsspennu og tryggir nána snertingu við vef í nægjanlega langan tíma til þess að fá viðunandi deyfingu í langan tíma (um 20-30 mín.). Deyfing kemur venjulega fljótt fram (innan 5 mín. háð því svæði sem það er notað á).

Lidocain, eins og önnur staðdeyfilyf, veldur tímabundinni stöðvun á útbreiðslu taugaboða og kemur í veg fyrir innflæði natríumjóna gegnum taugahimnur. Staðdeyfilyf af flokki amíða eru talin verka á natríumgöng taugahimna.

Staðdeyfilyf geta einnig haft svipuð áhrif á ertanlegar himnur í heila og hjartavöðva. Ef of mikið magn af lyfinu berst hratt um æðakerfið, fer að bera á einkennum eitrunar sem eiga upptök sín í miðtaugakerfi og hjarta- og æðakerfinu.

Eitrun á miðtaugakerfi kemur venjulega fram á undan einkennum frá hjarta- og æðakerfi þar sem hún á sér stað við lægri plasmabéttni. Bein áhrif staðdeyfilyfja á hjarta eru m.a. hæg leiðni, minnkaður samdráttarkraftur og mögulega hjartastopp.

5.2 Lyfjahvörf

Lidocain frásogast eftir að það er borið á slímhimnur. Hraði og magn þess sem frásogast fer eftir þéttni og heildarskammti sem notaður er, hvaða svæði lyfið er borið á og hversu lengi viðkomandi svæði er útsett fyrir lyfinu. Almenn er frásogshraði staðdeyfilyfja eftir staðbundna notkun mestur eftir notkun innan barka og berkja. Lidocain frásogast einnig vel frá meltingarvegi, en lítið magn af lyfinu finnst á óbreyttu formi í blóði vegna umbrots í lifur.

Venjulega er um 65% af lidocaini bundið plasmapróteinum. Staðdeyfilyf af amíðflokki eru aðallega bundin alfa-1-sýru glýkópróteinum en einnig albúmíni. Lidocain fer yfir blóð-heilahemil og yfir fylgju, sennilega með óvirku flæði.

Helsta brotthvarfsleið lidocains verður með umbroti í lifur. Umbrot hjá mönnum fellst aðallega í N-alkýlsviptingu í monoetylglycin xylidin (MEGX), sem síðan breytist í 2,6-xylidin vegna vatnsrofs og fyrir hydroxyltengingu í 4-hydroxy-2,6-xylidin. MEGX getur einnig orðið fyrir frekari alkýlsviptingu í glycin xylidin (GX). Lyfjafræðileg/eiturefnafræðileg virkni MEGX og GX eru svipuð en vægari en fyrir lidocain. GX hefur lengri helmingunartíma (um 10 klst.) en lidocain og getur safnast upp við langtíma notkun. Um 90% af lidocaini sem gefið er skilst út á formi ýmissa umbrotsefna og minna en

10% skilst óbreyttu formi í þvagi. Aðalumbrotsefnið í þvagi er samtengt 4-hydroxy-2,6-xylidin, sem er um 70-80% af þeim skammti sem skilst út í þvagi.

Helmingunartími brotthvarfs lidocains eftir inndælingu staks skammti í bláæð er venjulega 1,5-2 klst. Vegna mikils umbrotshraða lidocains veldur allt ástand sem hefur áhrif á lifrarstarfsemi breytingu á umbroti lidocains. Helmingunartími getur tvöfaldast eða meira hjá sjúklingum með vanstarfsemi lifrar. Vanstarfsemi nýrna breytir ekki umbroti lidocains en getur aukið uppsöfnun umbrotsefna.

Þættir eins og blóðsýring og notkun lyfja sem hafa örvandi eða slævandi áhrif á miðtaugakerfið hafa áhrif á þá þéttni lidocains í miðtaugakerfi sem veldur augljósum almennum áhrifum. Aukaverkanir verða enn augljósari með aukinni plasmáþéttni yfir 6,0 µg af fríum basa á hvern ml.

5.3 Forklínískar upplýsingar

Í dýrarannsóknum hafa komið fram eiturverkanir eftir stóra skammta af lidocaini, með verkunum á miðtaugakerfið og hjarta- og æðakerfið. Engar lyfjatengdar aukaverkanir hafa sést í rannsóknum á eiturverkun á æxlun. Ekki hefur verið sýnt fram á að lidocain hafi stökkbreytandi eiginleika, hvorki í *in vitro* né *in vivo* rannsóknum á stökkbreytandi eiginleikum. Rannsóknir á krabbameinsvaldandi áhrifum hafa ekki verið gerðar á lidocaini bæði vegna meðferðarlengdar og notkunarstaðar lyfsins.

Prófanir á eiturverkunum á erfðaeefni hafa ekki sýnt fram á stökkbreytandi eiginleika. Umbrotsefni lidocains, 2,6-xylidin sýndi veika virkni í nokkrum prófunum á eiturverkunum á erfðaeefni. Sýnt hefur verið fram á krabbameinsvaldandi eiginleika umbrotsefnisins 2,6-xylidins í forklínískum rannsóknum á eiturverkunum, þar sem lagt var mat á langvarandi útsetningu. Áhættumat, þar sem borin var saman útreiknuð hámarksútsetning hjá mönnum eftir slitrótta notkun lidocains við útsetningu í forklínískum rannsóknum, gefur til kynna að öryggi við klíníska notkun er mikið.

6. LYFJAGERÐARFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR

6.1 Hjálparefni

Hýprómellósi
Natríumhýdroxíð,
Saltsýra (pH 6,2-6,6)
Metýlparahýdroxýbenzóat (E218)
Própýlparahýdroxýbensóat
Vatn fyrir stungulyf.

6.2 Ósamrýmanleiki

Á ekki við.

6.3 Geymsluþol

2 ár.

Sýnt hefur verið fram á efnafræðilegan og eðlisfræðilegan stöðugleika í 28 daga við 25°C. Frá örverufræðilegu sjónarmiði má geyma lyfið að hámarki í 28 daga við 25°C eftir að umbúðir hafa verið rofnar. Geymsla í lengri tíma eða við aðrar aðstæður er á ábyrgð notandans.

6.4 Sérstakar varúðarreglur við geymslu

Geymið við lægri hita en 25°C. Má ekki frjósa.

6.5 Gerð íláts og innihald

Aspen Bad Oldesloe GmbH:

Áltúpa með gatanlegu innsigli og loki úr pólýprópýleni. Pakkningin er sæfð. Hver pakkning inniheldur CE-vottað lækningatæki (stjöku).
1 x 30 g.

Recipharm Karlskoga:

Áltúpa með loki úr pólýbútýlenterephthalati. Lokið er með gúmmíhring að innanverðu. Pakkningin er sæfð. Hver pakkning inniheldur CE-vottað lækningatæki (stjöku).
1 x 30 g.

6.6 Sérstakar varúðarráðstafanir við förgun og önnur meðhöndlun

Farga skal öllum lyfjaleifum og/eða úrgangi í samræmi við gildandi reglur.

7. MARKAÐSLEYFISHAFI

Aspen Pharma Trading Limited
3016 Lake Drive,
Citywest Business Campus,
Dublin 24,
Írland

8. MARKAÐSLEYFISNÚMER

Xylocain, hlaup 20 mg/g: MTnr 843388.

**9. DAGSETNING FYRSTU ÚTGÁFU MARKAÐSLEYFIS/ENDURNÝJUNAR
MARKAÐSLEYFIS**

Dagsetning fyrstu útgáfu markaðsleyfis: 1. maí 1978.
Nýjasta dagsetning endurnýjunar markaðsleyfis: 9. desember 2010.

10. DAGSETNING ENDURSKOÐUNAR TEXTANS

14. janúar 2025.